

DERWENT-ACC-NO: 1993-077508

DERWENT-WEEK: 199610

COPYRIGHT 2007 DERWENT INFORMATION LTD

TITLE: New dandruff treatment method - uses DL-valine
and/or its ester(s) and/or salts as active ingredient
in e.g. shampoo, gel etc.

INVENTOR: KAUFMANN, W; ROETHLISBERGER, R ; SCHNETZ, M

PATENT-ASSIGNEE: WELLA AG[WELA]

PRIORITY-DATA: 1991DE-4128518 (August 28, 1991)

PATENT-FAMILY:

| PUB-NO | MAIN-IPC | PUB-DATE | LANGUAGE |
|-------------|-------------|------------------|----------|
| DE 4128518 | A1 | March 4, 1993 | N/A |
| 003 | A61K 007/06 | | |
| ES 2054599 | T3 | January 16, 1996 | N/A |
| 000 | A61K 007/06 | | |
| WO 9304661 | A1 | March 18, 1993 | G |
| 013 | A61K 007/06 | | |
| EP 554422 | A1 | August 11, 1993 | G |
| 013 | A61K 007/06 | | |
| ES 2054599 | T1 | August 16, 1994 | N/A |
| 000 | A61K 007/06 | | |
| EP 554422 | B1 | August 30, 1995 | G |
| 004 | A61K 007/06 | | |
| DE 59203472 | G | October 5, 1995 | N/A |
| 000 | A61K 007/06 | | |

DESIGNATED-STATES: US AT BE CH DE DK ES FR GB GR IE IT LU MC NL SE DE
ES FR GB
IT DE ES FR GB IT

CITED-DOCUMENTS: DE 3541485; EP 413528 ; EP 4135285

APPLICATION-DATA:

| PUB-NO | APPL-DESCRIPTOR | APPL-NO |
|-----------------|-----------------|----------------|
| DE 4128518A1 | N/A | 1991DE-4128518 |
| August 28, 1991 | | |
| ES 2054599T3 | N/A | 1992EP-0916898 |

| | | |
|----------------|----------|----------------|
| August 5, 1992 | | |
| ES 2054599T3 | Based on | EP 554422 |
| N/A | | |
| WO 9304661A1 | N/A | 1992WO-EP01769 |
| August 5, 1992 | | |
| EP 554422A1 | N/A | 1992EP-0916898 |
| August 5, 1992 | | |
| EP 554422A1 | N/A | 1992WO-EP01769 |
| August 5, 1992 | | |
| EP 554422A1 | Based on | WO 9304661 |
| N/A | | |
| ES 2054599T1 | N/A | 1992EP-0916898 |
| August 5, 1992 | | |
| ES 2054599T1 | Based on | EP 554422 |
| N/A | | |
| EP 554422B1 | N/A | 1992EP-0916898 |
| August 5, 1992 | | |
| EP 554422B1 | N/A | 1992WO-EP01769 |
| August 5, 1992 | | |
| EP 554422B1 | Based on | WO 9304661 |
| N/A | | |
| DE 59203472G | N/A | 1992DE-0503472 |
| August 5, 1992 | | |
| DE 59203472G | N/A | 1992EP-0916898 |
| August 5, 1992 | | |
| DE 59203472G | N/A | 1992WO-EP01769 |
| August 5, 1992 | | |
| DE 59203472G | Based on | EP 554422 |
| N/A | | |
| DE 59203472G | Based on | WO 9304661 |
| N/A | | |

INT-CL (IPC): A61K007/06, A61K007/075 , A61K007/08 , A61K007/11

ABSTRACTED-PUB-NO: DE 4128518A

BASIC-ABSTRACT:

Use of DL-valine (I) (and/or its esters and/or salts) in treatment of dandruff, is new.

Pref. the ester is the methyl or ethyl ester, and the salt is the hydrochloride, sulphate or acetate salt. The active agent can be applied in, e.g., a shampoo, gel, cream or spray. The compsn. contains 0.05-10 wt.% of active agent, and is based on water, alcohol or water-alcohol.

USE/ADVANTAGE - Use of (I) avoids the problems associated with previous methods of treating dandruff, such as poor solubility of active agent in the cosmetic carrier, or poor physiological tolerability of the active agent

ABSTRACTED-PUB-NO: EP 554422B

EQUIVALENT-ABSTRACTS:

Cosmetic use of DL-valine and/or DL-valine esters and/or DL-valine salts for the treatment of dandruff.

CHOSEN-DRAWING: Dwg.0/0 Dwg.0/0

TITLE-TERMS: NEW DANDRUFF TREAT METHOD DL VALINE ESTER SALT ACTIVE INGREDIENT
SHAMPOO GEL

DERWENT-CLASS: B05 D21 E16

CPI-CODES: B10-B02J; B12-L05; D08-B03; D08-B09A; E10-B02D6;

CHEMICAL-CODES:

Chemical Indexing M2 *01*

Fragmentation Code

H1 H100 H181 J0 J011 J171 J271 M210 M211 M212
M213 M214 M215 M216 M220 M221 M222 M223 M224 M225
M226 M231 M232 M233 M272 M280 M281 M314 M321 M333
M340 M342 M349 M381 M391 M416 M620 M640 M650 M781
M903 M904 P930 R021 R022 R023

Markush Compounds

199310-02401-U

UNLINKED-DERWENT-REGISTRY-NUMBERS: 0312U

SECONDARY-ACC-NO:

CPI Secondary Accession Numbers: C1993-034184



①9 BUNDESREPUBLIK
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES
PATENTAMT

⑫ **Offenlegungsschrift**
⑩ **DE 41 28 518 A 1**

⑤ Int. Cl.⁵:
A 61 K 7/06
A 61 K 7/075
A 61 K 7/08
A 61 K 7/11
// C07C 229/08

⑳ Aktenzeichen: P 41 28 518.2
㉔ Anmeldetag: 28. 8. 91
㉕ Offenlegungstag: 4. 3. 93

DE 41 28 518 A 1

㉚ Anmelder:
Wella AG, 6100 Darmstadt, DE

㉚ Erfinder:
Röthlisberger, Rudi, Dr.; Schnetz, Michel, Marly, CH;
Kaufmann, Walter, 6109 Mühlthal, DE

⑤4 Verwendung von DL-Valin, dessen Estern und/oder Salzen zur Bekämpfung von Kopfschuppen

⑤7 Die Erfindung betrifft die Verwendung von DL-Valin, dessen Estern und/oder Salzen zur Bekämpfung von Kopfschuppen. Das DL-Valin, dessen Ester und/oder Salze werden vorzugsweise in einer Konzentration von 0,05 bis 10 Gewichtsprozent angewendet.

DE 41 28 518 A 1

Beschreibung

Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist die Verwendung von DL-Valin, dessen Estern und/oder Salzen zur Bekämpfung von Kopfschuppen.

Es sind bereits zahlreiche Substanzen als Wirkstoffe zur Bekämpfung der Kopfschuppen ("Antischuppenwirkstoffe") empfohlen worden. Hierzu gehören Verbindungen wie kolloidaler Schwefel, Hydroxychinoline, Phenole, quartäre Ammoniumverbindungen, Selendisulfid, Pyridinthione, Thiazolverbindungen und zahlreiche andere Verbindungen.

Von den genannten Verbindungen weisen das 1-Hydroxy-2-pyridinthion und dessen Salze, insbesondere das Zinksalz, eine besonders gute Wirksamkeit bei Kopfschuppen auf. Aufgrund der in üblichen Lösungsmitteln wie Wasser und Alkoholen begrenzten Löslichkeit des Zink-Pyridinthions kann es jedoch nur unter Schwierigkeiten in klare kosmetische Mittel eingearbeitet werden.

Die bisher als Wirkstoffe zur Behandlung der Kopfschuppen vorgeschlagenen Verbindungen können hinsichtlich ihrer Wirksamkeit gegen Kopfschuppen in toxikologischer und dermatologischer Hinsicht, oder — wie im Falle des Zink-Pyridinthions — wegen der Schwerlöslichkeit in kosmetischen Lösungsmitteln, den gestellten Anforderungen nicht völlig zufriedenstellend genügen.

Zur Lösung dieses Problems wurde in der eigenen DE-OS 29 37 184, DE-OS 29 38 418, DE-OS 30 45 340 und DE-OS 38 03 783 vorgeschlagen, bestimmte 1,3-Thiazolidine oder Tetrahydro-1,3-thiazinderivate als Antischuppen-Wirkstoffe einzusetzen. Die Verbindungen weisen zwar eine bessere Löslichkeit in den für kosmetische Mittel gebräuchlichen Lösungsmitteln auf, jedoch ist ihre Antischuppenwirkung nicht völlig zufriedenstellend.

Alle bis heute bekannten Antischuppen-Wirkstoffe weisen zudem einen kosmetischen Nebeneffekt auf, der von der Mehrzahl der Verwender nicht akzeptiert werden kann: Eine starke Haarbelastung im Sinne einer stärkeren Nachfettung der Kopfhaut sowie des Haares. Die Ursache für diese Nebenwirkung ist bis heute ungeklärt. Es wurden zahlreiche Hypothesen aufgestellt, die nach experimenteller Überprüfung jedoch nicht bestätigt werden konnten. Untersuchungen an breiten Probandenkollektiven zeigten, daß keine Stimulierung der Sebumproduktion durch die Antischuppen-Wirkstoffe erfolgt; eine wesentliche Veränderung der Sebum-Zusammensetzung konnte ebenfalls nicht nachgewiesen werden. Unabhängig auch von anderen Hypothesen, die aufgestellt worden sind, stellt diese Haarbelastung für die betroffenen Verwender ein kosmetisches Problem dar.

Weiterhin handelt es sich bei den heute am häufigsten verwendeten gegen Kopfschuppen wirksamen Verbindungen, wie zum Beispiel Selendisulfid, Zinkpyridinthion oder 1-(4-Chlorphenoxy)-1-(1-imidazolyl)-3,3-dimethyl-2-butanon ("Climabazol"), um Substanzen, welche zwar eine gute Wirksamkeit gegen Kopfschuppen besitzen, deren physiologische Verträglichkeit jedoch nicht unumstritten ist.

Es bestand daher die Aufgabe, einen Wirkstoff gegen Kopfschuppen zur Verfügung zu stellen, der die vorstehend genannten Nachteile, insbesondere bezüglich der Löslichkeit, der physiologischen Verträglichkeit sowie der Nachfettung der Haare, nicht aufweist.

Es wurde nun überraschenderweise gefunden, daß

DL-Valin, DL-Valinester oder DL-Valinsalze, alleine oder in Kombination miteinander, diese Aufgabe in hervorragender Weise lösen.

Insbesondere weisen DL-Valin, DL-Valinester und DL-Valinsalze eine gute Wirksamkeit gegen Kopfschuppen und eine ausgezeichnete physiologische Verträglichkeit auf und lassen sich aufgrund ihrer guten Löslichkeit in den üblicherweise in kosmetischen Mitteln verwendeten Lösungsmitteln problemlos in klare kosmetische Zubereitungen einarbeiten.

Im Gegensatz zu den üblicherweise verwendeten Antischuppenwirkstoffen tritt bei Verwendung von DL-Valin, dessen Salzen oder Estern keinerlei Nachfettung der Haare auf.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist daher die Verwendung von DL-Valin und/oder DL-Valinestern und/oder DL-Valinsalzen zur Bekämpfung von Kopfschuppen.

Als DL-Valinester kommen vorzugsweise DL-Valinmethylester und DL-Valinethylester in Betracht, während als DL-Valinsalze die physiologisch verträglichen Salze des DL-Valins, insbesondere DL-Valinhydrochlorid, DL-Valinsulfat und DL-Valinacetat, zu nennen sind.

Gemäß der vorliegenden Erfindung sollen DL-Valin, DL-Valinester und/oder DL-Valinsalze in beliebigen, für die Haar- und Kopfbehandlung geeigneten kosmetischen Zubereitungen auf wäßriger, alkoholischer oder wäßrig-alkoholischer Basis, wie zum Beispiel in Einlegemitteln, Haarspülungen, Frisiergels, Frisiercremes, Haarkuren, Haarfestigern oder Haarsprays, vorzugsweise jedoch in Shampoos und Haarwässern, in einer Menge von 0,05 bis 10 Gewichtsprozent Verwendung finden.

Es handelt sich dabei um Zubereitungen, die je nach ihrem Anwendungszweck für kürzere oder längere Zeit auf dem Haar und der Kopfhaut verbleiben. Durch ihren Gehalt an DL-Valin und/oder DL-Valinestern und/oder DL-Valinsalzen wird hierbei gleichzeitig eine Schuppenbehandlung bewirkt. Es ist jedoch auch möglich, Zubereitungen herzustellen, die hauptsächlich oder ausschließlich dem Ziel einer Schuppenbekämpfung dienen.

Die Menge an DL-Valin und/oder DL-Valinestern und/oder DL-Valinsalzen beträgt in den Mitteln zur Behandlung der Haare und der Kopfhaut, welche nach der Anwendung nicht ausgespült werden und daher auf dem Haar und der Kopfhaut verbleiben, wie zum Beispiel in Haarwässern und Einlegemitteln, etwa 0,05 bis 1 Gewichtsprozent vorzugsweise 0,1 bis 0,5 Gewichtsprozent. Mittel, die kurz nach ihrer Anwendung ausgespült werden, wie beispielsweise Shampoos und Haarspülungen, enthalten das DL-Valin, die DL-Valinester und/oder die DL-Valinsalze in einer Menge von etwa 0,5 bis 10 Gewichtsprozent, vorzugsweise in einer Menge von 2 bis 5 Gewichtsprozent. Hierbei können die genannten Verbindungen jeweils allein oder im Gemisch miteinander in diesen Zubereitungen vorliegen.

Der pH-Wert dieser kosmetischen Zubereitungen beträgt 3 bis 9, vorzugsweise 5 bis 8.

Die Zusammensetzung dieser kosmetischen Zubereitungen stellt eine Mischung von DL-Valin und/oder DL-Valinestern und/oder DL-Valinsalzen mit den für solche Zubereitungen üblichen Bestandteilen, wie zum Beispiel Träger- und Zusatzstoffen, dar.

Der kosmetische Trägerstoff kann ein für die örtliche Anwendung üblicher Trägerstoff, wie eine Salbengrundlage oder vor allem ein flüssiger Trägerstoff, wie Wasser, Alkohole oder wäßrig-alkoholische Mischung-

gen, sein. Hierfür geeignete Alkohole sind beispielsweise Ethanol, n-Propanol, i-Propanol sowie auch mehrwertige Alkohole wie Glycerin und Propylenglykol.

Flüssige Trägerstoffe wie Wasser und Alkohole sind deshalb besonders bevorzugt, weil sich bei ihrer Verwendung meist klare Lösungen ergeben und diese Trägerstoffe eine besonders intensive Benetzung der Kopfhaut ermöglichen.

Als übliche Zusatzstoffe in den kosmetischen Zubereitungen kommen beispielsweise kosmetische Harze; Emulgatoren; anionische, kationische, nicht-ionische oder amphotere Tenside; Verdicker, wie zum Beispiel höhere Fettalkohole, Stärke; Cellulosederivate, Paraffinöl, ferner Pflegestoffe, wie beispielsweise Lanolinderivate, Cholesterin oder Pantothenensäure; sowie weiterhin Farbstoffe; Parfümöle; Treibgase und andere in Betracht.

Die nachstehenden Beispiele sollen den Gegenstand der Erfindung näher erläutern ohne ihn hierauf zu beschränken.

Beispiele

Beispiel 1

Klares Haarshampoo

| | |
|---------|--|
| 5,0 g | DL-Valin |
| 11,2 g | Natriumlaurylalkoholdiglykoethersulfat |
| 4,0 g | Natriumchlorid |
| 0,2 g | Parfümöl |
| 79,6 g | Wasser |
| 100,0 g | |

Beispiel 2

Klares Haarwasser

| | |
|---------|-------------|
| 0,5 g | DL-Valin |
| 0,2 g | Parfümöl |
| 50,0 g | Isopropanol |
| 49,3 g | Wasser |
| 100,0 g | |

Beispiel 3

Einlegemittel

| | |
|---------|--|
| 0,5 g | DL-Valinmethylester |
| 3,0 g | Vinylpyrrolidon/Vinylacetat-Copolymerisat 60/40 (Luviskol® VA 64 der Firma BASF, Ludwigshafen/BRD) |
| 0,2 g | Parfümöl |
| 40,0 g | Ethanol |
| 56,3 g | Wasser |
| 100,0 g | |

Patentansprüche

1. Verwendung von DL-Valin und/oder DL-Valinestern und/oder DL-Valinsalzen zur Bekämpfung von Kopfschuppen.
2. Verwendung von DL-Valin und/oder DL-Valinestern und/oder DL-Valinsalzen nach Anspruch 1 in

einer Menge von 0,05 bis 10 Gewichtsprozent in einer kosmetischen Zubereitung auf wäßriger, alkoholischer oder wäßrig-alkoholischer Basis.

3. Verwendung von DL-Valin und/oder DL-Valinestern und/oder DL-Valinsalzen nach Anspruch 1 oder 2 in einer Menge von 0,05 bis 1 Gewichtsprozent in Mitteln zur Behandlung der Haare und der Kopfhaut, welche nach der Anwendung nicht ausgespült werden.

4. Verwendung von DL-Valin und/oder DL-Valinestern und/oder DL-Valinsalzen nach Anspruch 1 oder 2 in einer Menge von 0,5 bis 10 Gewichtsprozent in Mitteln zur Behandlung der Haare und der Kopfhaut, welche nach der Anwendung ausgespült werden.

5. Verwendung nach einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, daß der DL-Valinester ausgewählt ist aus DL-Valinmethylester und DL-Valinethylester.

6. Verwendung nach einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, daß das DL-Valinsalz ausgewählt ist aus DL-Valinhydrochlorid, DL-Valinsulfat und DL-Valinacetat.

7. Verwendung nach einem der Ansprüche 1 bis 6, dadurch gekennzeichnet, daß das DL-Valin und/oder der DL-Valinester und/oder das DL-Valinsalz in einer kosmetischen Zubereitung zur Anwendung gelangt, die als Haarspülung, Einlegemittel, Frisiergel, Frisiercreme, Haarkur, Haarfestiger, Haarspray, Shampoo oder Haarwasser vorliegt.